

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局(43) 国際公開日
2003 年 7 月 17 日 (17.07.2003)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 03/058233 A1

- (51) 国際特許分類: G01N 33/15, 33/50, 33/566,
A61K 45/00, A61P 31/10, C07K 14/195
- (21) 国際出願番号: PCT/JP02/13807
- (22) 国際出願日: 2002 年 12 月 27 日 (27.12.2002)
- (25) 国際出願の言語: 日本語
- (26) 国際公開の言語: 日本語
- (30) 優先権データ:
特願 2001-401947
2001 年 12 月 28 日 (28.12.2001) JP
- (71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): エーザ
イ株式会社 (EISAI CO., LTD.) [JP/JP]; 〒112-8088 東
京都 文京区 小石川 4 丁目 6 番 10 号 Tokyo (JP).
- (72) 発明者: および
- (75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 塚原 克平

(TSUKAHARA, Kappei) [JP/JP]; 〒305-0051 茨城
県 つくば市 二の宮 4-4-24 Ibaraki (JP). 佐藤
俊孝 (SATO, Toshitaka) [JP/JP]; 〒301-0042 茨城
県 竜ヶ崎市長山 8-6-7 Ibaraki (JP). 中本 和孝
(NAKAMOTO, Kazutaka) [JP/JP]; 〒305-0031 茨城
県 つくば市 吾妻 3-15-8 ヒロ・ビージャ
402 Ibaraki (JP). 土谷 満美子 (TSUCHIYA, Mamiko)
[JP/JP]; 〒300-1216 茨城県 牛久市 神谷 6 丁目 22-1
シエルヒープ B-103 Ibaraki (JP). 相根 康司
(SAGANE, Koji) [JP/JP]; 〒305-0061 茨城県 つくば市
稲荷前 9-7 つくばね第 2 寮 303 Ibaraki (JP).

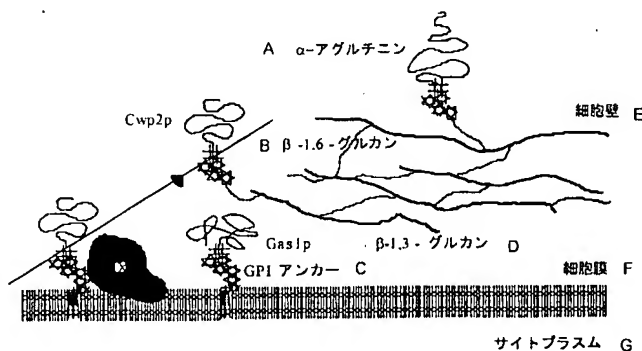
(74) 代理人: 清水 初志, 外 (SHIMIZU, Hatsushi et al.); 〒
300-0847 茨城県 土浦市 卸町 1-1-1 関鉄つくばビ
ル 6 階 Ibaraki (JP).

(81) 指定国 (国内): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB,
BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK,
DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU,
ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT,

[続葉有]

(54) Title: METHOD OF SCREENING COMPOUND HAVING FUNGAL CELL WALL SYNTHESIS INHIBITORY ACTIVITY

(54) 発明の名称: 真菌細胞壁合成阻害活性を有する化合物をスクリーニングする方法



A...α-AGGLUTININ
B...β-1,6-GLUCAN
C...GPI ANCHOR

D...β-1,3-GLUCAN
E...CELL WALL
F...CELL MEMBRANE
G...CYTOPLASM

(57) Abstract: By a simple binding assay with the
use of a membrane fraction in which GWT1 pro-
tein is expressed, a compound inhibiting the trans-
port of GPI anchor protein to fungal cell wall can be
screened.

(57) 要約:

GWT1 蛋白を発現した膜画分を用いた簡単な Binding assay により、GPI アンカ
ー蛋白質の真菌細胞壁への輸送を阻害する化合物がスクリーニング可能となった。



WO 03/058233 A1

Title: US-10-536-935A-1
Perfect score: 1497
Sequence: 1 atggcaacagtacatcagaa.....gaatattcattaagctataa 1497

RESULT 2

ADC18784

ID ADC18784 standard; DNA; 1497 BP.

XX

AC ADC18784;

XX

DT 18-DEC-2003 (first entry)

XX

DE *Saccharomyces cerevisiae* cell wall synthesis-related gene.

XX

KW screening; fungi; fungal cell wall synthesis-inhibition;

KW GPI anchor protein transport; antifungal agent; gene; ds; yeast.

XX

OS *Saccharomyces cerevisiae*.

XX

FH Key Location/Qualifiers

FT CDS 1..1497

FT /*tag= a

FT /product= "Saccharomyces cerevisiae cell wall synthesis-

FT related protein"

XX

PN WO2003058233-A1.

XX

PD 17-JUL-2003.

XX

PF 27-DEC-2002; 2002WO-JP013807.

XX

PR 28-DEC-2001; 2001JP-00401947.

XX

PA (EISA) EISAI CO LTD.

XX

PI Tsukahara K, Sato T, Nakamoto K, Tsuchiya M, Sagane K;

XX

DR WPI; 2003-627339/59.

DR P-PSDB; ADC18785.

XX

PT Method for screening compounds having fungal cell wall synthesis-

PT inhibitory activity by binding assay with a membrane fraction expressing

PT GWT1 protein to give inhibitors on transport of GPI anchor proteins.

XX

PS Claim 1; SEQ ID NO 1; 202pp; Japanese.

XX

CC The invention comprises a method for screening compounds with effects on
CC fungi. The method is useful for screening compounds having fungal cell
CC wall synthesis-inhibitory activity, to give inhibitors on the transport
CC of GPI anchor protein as antifungal agents. The present DNA sequence
CC represents a gene of the invention.

XX

SQ Sequence 1497 BP; 429 A; 269 C; 275 G; 524 T; 0 U; 0 Other;

Query Match 100.0%; Score 1497; DB 10; Length 1497;
Best Local Similarity 100.0%; Pred. No. 0;
Matches 1497; Conservative 0; Mismatches 0; Indels 0; Gaps 0;

Qy 1
ATGGCAACAGTACATCAGAAGAATATGTCGACTTTAAACAGAGAAAAGAG
GACTTTGTG 60

|||||

Db 1
ATGGCAACAGTACATCAGAAGAATATGTCGACTTTAAACAGAGAAAAGAG
GACTTTGTG 60

Qy 61
ACAGGGCTCAATGGCGGTTCTATAACAGAAATTAACGCAGTGACATCAATTG
CTTTGGTA 120

|||||

Db 61
ACAGGGCTCAATGGCGGTTCTATAACAGAAATTAACGCAGTGACATCAATTG
CTTTGGTA 120

Qy 121
ACTTACATATCATGGAAGTTATTGAAAAATTCCAACCTTATGCCTCCTGGCAT
TTCCAGC 180

|||||

Db 121
ACTTACATATCATGGAAGTTATTGAAAAATTCCAACCTTATGCCTCCTGGCAT
TTCCAGC 180

Qy 181
GTGCAATACATAATTGATTTTGCATTGAACTGGGTTGCTTTGCTTCTATCTATT
ACTATT 240

|||||

Db 181
GTGCAATACATAATTGATTTTGCATTGAACTGGGTTGCTTTGCTTCTATCTATT
ACTATT 240

Qy 241
TATGCTAGTGAACCATACCTTCTAAACACGCTAATACTGTTACCTTGTTTGCT
CGCATTC 300

|||||

Db 241
TATGCTAGTGAACCATACCTTCTAAACACGCTAATACTGTTACCTTGTTTGCT
CGCATTC 300

Qy 301
ATATATGGAAAATTTACTAGCTCGAGTAAACCTTCTAATCCAATATACAATAA
AAAAAAA 360

|||||

Db 301
ATATATGGAAAATTTACTAGCTCGAGTAAACCTTCTAATCCAATATACAATAA
AAAAAAA 360

Qy 361
ATGATTACACAGCGGTTCCAACCTAGAAAAAAAGCCGTATATTACTGCGTATC
GTGGTGGG 420

|||||

Db 361
ATGATTACACAGCGGTTCCAACCTAGAAAAAAAGCCGTATATTACTGCGTATC
GTGGTGGG 420

Qy 421
ATGCTTATTCTGACTGCTATTGCCATCTTGGCTGTAGATTTTCCAATTTTCCCA
AGGAGG 480

|||||

Db 421
ATGCTTATTCTGACTGCTATTGCCATCTTGGCTGTAGATTTTCCAATTTTCCCA
AGGAGG 480

Qy 481
TTTGCCAAGGTGGAACTTGGGGGACATCCCTGATGGATCTTGGTGTAGGAT
CATTCGTT 540

|||||

Db 481
TTTGCCAAGGTGGAACTTGGGGGACATCCCTGATGGATCTTGGTGTAGGAT
CATTCGTT 540

Qy 541
TTCAGTAACGGTATTGTTTCTTCTAGGGCACTGTTGAAAAACCTAAGCTTGAA
GAGTAA 600

|||||

Db 541
TTCAGTAACGGTATTGTTTCTTCTAGGGCACTGTTGAAAAACCTAAGCTTGAA
GAGTAAA 600

Qy 601
CCCAGCTTCTTAAAAAATGCATTTAATGCCTTAAAATCAGGAGGAACTCTATT
GTTCCCTA 660

|||||

Db 601
CCCAGCTTCTTAAAAAATGCATTTAATGCCTTAAAATCAGGAGGAACTCTATT
GTTCCCTA 660

Qy 661
GGATTGCTGAGGTTGTTTTTTGTAAAAAATTTGGAATATCAAGAACATGTCAC
AGAATAT 720

|||||

Db 661
GGATTGCTGAGGTTGTTTTTTGTAAAAAATTTGGAATATCAAGAACATGTCAC
AGAATAT 720

Qy 721
GGGGTTCATTGGAATTTTTTTATCACCTATCATTGTTGCCACTTGTATTGACC
TTTATT 780

|||||

Db 721
GGGGTTCATTGGAATTTTTTTATCACCTATCATTGTTGCCACTTGTATTGACC
TTTATT 780

Qy 781
GATCCCGTCACAAGAATGGTTCCACGCTGCTCAATTGCAATATTCATTTTCATG
CATTTAT 840

|||||

Db 781
GATCCCGTCACAAGAATGGTTCCACGCTGCTCAATTGCAATATTCATTTTCATG
CATTTAT 840

Qy 841
GAATGGCTACTTTTAAAGGACGATCGCACTTTAACTTTTTAATTTTGGCTGA
TAGAAAT 900

|||||

Db 841
GAATGGCTACTTTTAAAGGACGATCGCACTTTAACTTTTTAATTTTGGCTGA
TAGAAAT 900

Qy 901
TGTTTCTTCAGTGCTAATAGAGAAGGCATCTTCTCATTTCTAGGTTATTGCTCG
ATTTTT 960

|||||

Db 901
TGTTTCTTCAGTGCTAATAGAGAAGGCATCTTCTCATTTCTAGGTTATTGCTCG
ATTTTT 960

Qy 961
CTTTGGGGCCAAAACACGGGATTTTACTTGTTGGGAAATAAACCAACTTTAA
ACAATCTT 1020

|||||

Db 961
CTTTGGGGCCAAAACACGGGATTTTACTTGTTGGGAAATAAACCAACTTTAA
ACAATCTT 1020

Qy 1021
TATAAGCCTTCTACGCAAGACGTAGTTGCAGCATCAAAGAAGTCTTCGACTT
GGGACTAT 1080

|||||

Db 1021
TATAAGCCTTCTACGCAAGACGTAGTTGCAGCATCAAAGAAGTCTTCGACTT
GGGACTAT 1080

Qy 1081
TGGACTTCAGTAACCCCATTAAGTGGCCTCTGTATATGGAGTACAATTTTCT
TGTTATC 1140

|||||

Db 1081
TGGACTTCAGTAACCCCATTAAGTGGCCTCTGTATATGGAGTACAATTTTCT
TGTTATC 1140

Qy 1141
AGCCAGTTGGTTTTTCAATACCATCCTTATAGTGTTTCAAGAAGGTTTGCTAA
CTTACCA 1200

|||||

Db 1141
AGCCAGTTGGTTTTTCAATACCATCCTTATAGTGTTTCAAGAAGGTTTGCTAA
CTTACCA 1200

Qy 1201
TATACTTTGTGGGTCATTACTTATAATTTACTATTTTGGACTGGGTACTGCTTG
ACTGAC 1260

|||||

Db 1201
TATACTTTGTGGGTCATTACTTATAATTTACTATTTTGGACTGGGTACTGCTTG
ACTGAC 1260

Qy 1261
AAAATTTTCGGTAATTCTTCGGAATATTATAAAGTTGCCGAATGCTTGGAATC
AATCAAC 1320

|||||

Db 1261
AAAATTTTCGGTAATTCTTCGGAATATTATAAAGTTGCCGAATGCTTGGAATC
AATCAAC 1320

Qy 1321
TCCAATGGGTTGTTTTATTTTGTGGCAAATGTCTCTACTGGTTTAGTCAAT
ATGTCT 1380

|||||

Db 1321
TCCAATGGGTTGTTTTATTTTGTGGCAAATGTCTCTACTGGTTTAGTCAAT
ATGTCT 1380

Qy 1381
ATGGTCACGATAGATTCTTCACCCTTAAAATCATTCTGGTTTTGTTGGCATA
CTGCTCA 1440

|||||

Db 1381
ATGGTCACGATAGATTCTTCACCCTTAAAATCATTCTGGTTTTGTTGGCATA
CTGCTCA 1440

Qy 1441
TTCATAGCTGTCATATCGGTTTTCTTGTATAGAAAAGAATATTCATTAAGCT
ATAA 1497

|||||

Db 1441
TTCATAGCTGTCATATCGGTTTTCTTGTATAGAAAAGAATATTCATTAAGCT
ATAA 1497